

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005 年 3 月 17 日 (17.03.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/023248 A1(51) 国際特許分類⁷: A61K 31/4178, A61P 43/00 // C07D 403/14, C12N 15/09, C07K 5/023, 5/027, 5/037

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/012854

(22) 国際出願日: 2004 年 9 月 3 日 (03.09.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

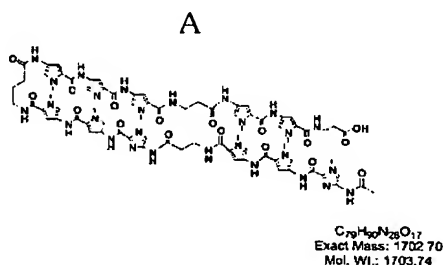
(30) 優先権データ:
特願2003-312365 2003 年 9 月 4 日 (04.09.2003) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 学校法人
日本大学 (NIHON UNIVERSITY) [JP/JP]; 〒1028275
東京都千代田区九段南四丁目 8 番 2 4 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者 / 出願人 (米国についてのみ): 福田 昇
(FUKUDA, Noboru) [JP/JP]; 〒1028275 東京都千代
田区九段南四丁目 8 番 2 4 号 学校法人日本大学内
Tokyo (JP). 岸岡 博文 (KISHIOKA, Hirofumi) [JP/JP];
〒1028275 東京都千代田区九段南四丁目 8 番 2 4 号
学校法人日本大学内 Tokyo (JP). 杉山 弘 (SUGIYAMA,
Hiroshi) [JP/JP]; 〒6020847 京都府京都市上京区大宮
町今出川通下ル薬師町 2 2 5-9 0 3 Kyoto (JP).(74) 代理人: 浅村 皓, 外 (ASAMURA, Kiyoshi et al.); 〒
1000004 東京都千代田区大手町 2 丁目 2 番 1 号 新大
手町ビル 3 3 1 Tokyo (JP).(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NL, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,
IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF,
BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,
TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

— 電子形式により別個に公開された明細書の配列表部
分、請求に基づき国際事務局から入手可能2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。(54) Title: TGF- β GENE EXPRESSION INHIBITOR(54) 発明の名称: TGF- β 遺伝子発現抑制剤

to an A-T base pair and a T-A base pair.

(57) Abstract: A TGF- β gene expression inhibitor containing a
pyrrole-imidazole polyamide having N-methylpyrrole unit (hereinafter
also called Py), N-methylimidazole unit (hereinafter also called Im) and
 γ -aminobutyrate unit which can be held into an U-shaped conformation
at the γ -aminobutyrate unit in the minor groove in a double helix region
(hereinafter called the target region) containing a complementary chain
corresponding to the sequence at the -557 to -536 in the base sequence of
a human transforming growth factor β 1 (hereinafter also called hTGF- β 1)
promoter, either as a whole or a part thereof: TAAAGGAGAGCAATTCT-
TACAG wherein a Py/Im pair corresponds to a C-G base pair, an Im/Py pair
corresponds to a G-C base pair, and Py/Py pairs correspond respectively(57) 要約: N-メチルピロール単位 (以下 Py とも言う)、N-メチルイミダゾール単位 (以下 Im とも
言う) 及び γ -アミノ酪酸単位を含むピロールイミダゾールポリアミドであって、ヒトトランスフォーミング
成長因子 β 1 (以下 hTGF- β 1 とも言う) プロモーターの以下に示す塩基配列 -557 ~ -536
TAAAGGAGAGCAATTCTTACAG の一部又は全部とこれに対する相補鎖を含む二重らせん領域 (以
下標的領域と言う) の副溝内において、前記 γ -アミノ酪酸単位の部位で折りたたまれた U 字型のコンフォメ
ーションをとることができ、C-G 塩基対に対しては Py/Im 対が、G-C 塩基対に対しては Im/Py 対が、
A-T 塩基対及び T-A 塩基対に対してはいずれも Py/Py 対がそれぞれ対応する、上記ピロールイミダゾール
ポリアミドを含んでなる TGF- β 遺伝子発現抑制剤。